

BEST AVAILABLE COPY

(19) BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND



DEUTSCHES

PATENTAMT

(12) Offenlegungsschrift
(11) DE 3807532 A1

(51) Int. Cl. 4:

C07D 239/32

C 07 D 401/12

C 07 D 405/12

C 07 D 403/12

C 07 D 409/12

A 01 N 43/54

// (C07D 239/32,

213:24,333:06,307:38,

239:26,235:14)

DE 3807532 A1

(21) Aktenzeichen: P 38 07 532.6
(22) Anmeldetag: 8. 3. 88
(43) Offenlegungstag: 21. 9. 89

(71) Anmelder:

Hoechst AG, 6230 Frankfurt, DE

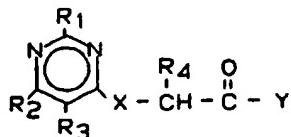
C
PAUL

(72) Erfinder:

Giencke, Wolfgang, Dr., 6238 Hofheim, DE;
Schlegel, Günter, Dr., 6233 Kelkheim, DE; Bieringer,
Hermann, Dr., 6239 Vockenhausen, DE; Bauer, Klaus,
Dr., 6450 Hanau, DE

(54) Pyrimidin-Carbonsäuren, Verfahren zur Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide

Verbindungen der Formel I oder deren Salze, worin



R₁ Haloalkyl; R₂ Wasserstoff, Halogen, Cyano, (subst.)Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxy, Alkythio, Alkylsulfonyl, (subst.)Cyanoalkyl, (subst.)Phenoxy; R₃ Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Halogen oder Cyano; R₄ Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy; X O, S oder NR₅; und Y einen Rest -NR₅R₆ oder -OR₈ bedeuten, besitzen vorteilhafte herbizide Eigenschaften; sie eignen sich hervorragend zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Nutzpflanzenkulturen.

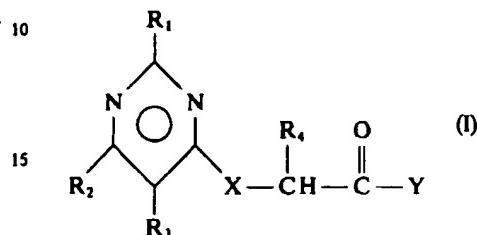
DE 3807532 A1

Beschreibung

Aus EP-A 2 12 969 sind Pyrimidinyloxyalkanamide mit herbiziden Eigenschaften bekannt.

Es wurde nun gefunden, daß Pyrimidin-Carbonsäure-Derivate, die im Pyrimidinteil spezielle Haloalkylreste tragen, eine hohe Selektivität bei ihrer Anwendung aufweisen, und daher zum Einsatz als Herbicide in der Landwirtschaft besonders geeignet sind.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel I oder deren Salze,



worin

R₁ ($C_1 - C_8$)-Haloalkyl;

R₂ Wasserstoff, Halogen, Cyano, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, Nitro, Cyano, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio oder $-NR_5R_6$ substituiert sein kann; ($C_2 - C_4$)-Alkenyl, ($C_2 - C_4$)-Alkinyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio, ($C_1 - C_4$)-Alkylsulfonyl, ($C_3 - C_8$)-Cycloalkyl, das durch ($C_1 - C_4$)-Alkyl ein- oder mehrfach substituiert sein kann; Phenoxy, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO₂ ($C_1 - C_4$ -Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkoxy substituiert ist;

R₃ Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, Halogen oder Cyano;

R₄ Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkoxy;

X O, S oder NR₅;

Y einen Rest $-NR_5R_6$ oder $-OR_8$;

R₅ Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl;

R₆ ($C_1 - C_4$)-Alkyl, CH₂R₇, Phenyl oder Naphthyl, die beide gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO₂, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, Cyano oder ($C_1 - C_4$)-Alkylthio substituiert sein können;

R₇ Phenyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO₂, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio oder Cyano substituiert ist, ($C_3 - C_8$)-Cycloalkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch ($C_1 - C_4$)-Alkyl substituiert sein kann, Furyl, Thienyl, Pyridyl oder Pyrimidinyl, wobei diese Reste jeweils gegebenenfalls durch Halogen, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl substituiert sein können; und

R₈ Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl

bedeuten, mit der Maßgabe, daß diejenigen Verbindungen der Formel I, worin R₁ CF₃, X Sauerstoff und R₆ $-CH_2R_7$ bedeutet, ausgenommen sind.

Diejenigen Verbindungen der Formel I, worin Y Hydroxy bedeutet, können Salze bilden, bei denen der Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird. Diese Salze sind im allgemeinen Metall-, insbesondere Alkali-, Erdalkali-, gegebenenfalls alkalierte Ammonium- oder Aminsalze. Halogen bedeutet insbesondere Fluor, Chlor oder Brom. Die Vorsilbe "Halo" in der Bezeichnung eines Substituenten bedeutet hier und im folgenden, daß dieser Substituent einfach oder mehrfach bei gleicher oder verschiedener Bedeutung auftreten kann. Die Vorsilbe Halo beinhaltet Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor, Chlor oder Brom. Als Beispiele für Haloalkyl seien genannt:

CCl₃, CHCl₂, CH₂Cl, CBr₃, CF₂Cl, CClF₂, CF₂CHF₂, CF₂CF₃, CF₂CHFCF₃, CF₂CHClF, CF₂CHCl₂, CCl₂CCl₃, n-C₃F₇, $-CH(CF_3)_2$, n-C₄F₉, n-C₅-F₁₁, n-C₆F₁₃, n-C₇F₁₅ und n-C₈F₁₇.

Halogen steht insbesondere für Chlor und Fluor.

Bevorzugte Verbindungen der Formel I sind solche, bei denen

R₁ ($C_1 - C_8$)-Haloalkyl, insbesondere die Reste $-CCl_3$, $-CF_2CHF_2$ oder $-CF_2CF_3$;

R₂ ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl oder ($C_3 - C_8$)-Cycloalkyl;

R₃ Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl oder Halogen;

R₄ Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkoxy;

X O oder S;

Y NR₅R₆ oder OR₈;

R₅ Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl;

R₆ $-CH_2R_7$, Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, NO₂, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy oder ($C_1 - C_4$)-Alkylthio substituiert sein kann;

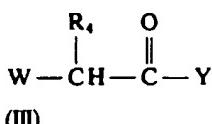
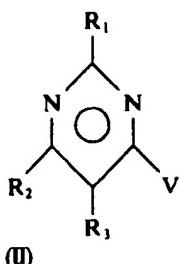
R₇ Phenyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, NO₂, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio oder Cyano substituiert sein kann;

R₈ Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl

bedeuten, mit der Maßgabe, daß diejenigen Verbindungen der Formel I, worin R₁ CF₃, X Sauerstoff und R₆ CH₂R₇ bedeutet, ausgenommen sind.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist auch ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II in Gegenwart einer Base mit einer Verbin-

dung



5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

der Formel III umsetzt.

Die Substituenten R_1 , R_2 , R_3 , R_4 und Y haben die Bedeutungen wie in der Formel I, V und W stehen für Halogen, Hydroxy, eine Gruppe NHR_5 oder SH , wobei für den Fall, daß W für Halogen steht, V Hydroxy, eine Gruppe NHR_5 oder SH bedeuten muß und für den Fall, daß V für Halogen steht, W Hydroxy, eine Gruppe NHR_5 oder SH bedeuten muß. Der Rest R_5 hat die in Formel I angegebene Bedeutung. Halogen repräsentiert hierbei Fluor, Chlor, Brom oder Jod, insbesondere Chlor oder Brom.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel II und III erfolgt vorzugsweise in inerten aprotischen Lösungsmitteln wie z. B. Acetonitril, Dichlormethan, Toluol, Xylool, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dialkylether wie Diethylen-glykol-dialkylether, insbesondere Diethylenglykoldimethylether, oder Dimethylformamid bei Temperaturen zwischen -10°C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels. Als Basen eignen sich die für diesen Reaktionstyp üblichen Basen wie beispielsweise Carbonate und Hydrogencarbonate von Alkali- oder Erdalkalimetallen, Alkalihydroxide, Alkalialkoholate wie z. B. K-tert.-butylat, tert.-Amine, Pyridin oder substituierte Pyridinbasen (z. B. 4-Dimethylaminopyridin).

Bei der Umsetzung der Verbindungen der Formeln II und III hat sich der Einsatz von Phasentransfer-Katalysatoren als sehr vorteilhaft erwiesen. Besonders für den Fall, daß V für Hydroxy, eine Gruppe NHR_5 oder SH und W für Halogen steht, wird in Gegenwart eines Phasentransferkatalysators die Reaktionszeit stark verkürzt und die Ausbeuten erheblich verbessert. Als Phasentransferkatalysatoren eignen sich beispielsweise quartäre Ammonium- und Phosphoniumsalze, Kronenether und Kryptanden wie sie in W.E. Keller, Phase-Transfer Reactions, Vol. I, II; 1985, 1986; Georg-Thieme-Verlag Stuttgart beschrieben sind.

Die Verbindungen der Formel II lassen sich nach grundsätzlich bekannten Verfahren synthetisieren (vgl. US-PS 43 43 803, DOS 36 44 799). Die Verbindungen der Formel III sind zum großen Teil bekannt und nach üblichen Methoden leicht zugänglich (vgl. J. Am. Chem. Soc. 70, 677; Chem. Berichte 70, 1836; Chem. Berichte 87, 537; Chem. Berichte 31, 3236).

Die erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel I weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstücken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Vorauflauf- oder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden. Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfundungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z. B. Avena, Kolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria etc. sowie Cyperusarten aus der annuellen Gruppe und auf Seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum etc. und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt.

Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon, Sida etc. auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex, Artemisia etc. bei den perennierenden Unkräutern.

Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Unkräuter wie z. B. Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus, Cyperus etc. werden von den erfundungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft.

Werden die erfundungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auslaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert, oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein, und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wuchsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit mehr oder weniger schnell ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig durch den Einsatz der neuen erfundungsgemäßen Mittel beseitigt werden kann.

Obgleich die erfundungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z. B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Die erfundungsgemäßen Mittel können als Spritzpulver, emulgierbare Konzentrate, Emulsionen, versprühba-

re Lösungen, Stäubemittel, Beizmittel, Dispersionen, Granulate, Mikrogranulate oder ULV-Formulierungen in den üblichen Zubereitungen angewendet werden.

Die biologischen und/oder chemischen-physikalischen Parameter des jeweiligen Wirkstoffes bestimmt die jeweils bevorzugte Art der zu verwendenden Formulierung.

5 Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer gegebenenfalls einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z. B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenylsulfonate und Dispergiermittel, z. B. ligninsulfonaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonaures Natrium, dibutynaphthalinsulfonaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Die Herstellung erfolgt in üblicher Weise, z. B. durch Mahlen und Vermischen der Komponenten.

10 Emulgierbare Konzentrate können z. B. durch Auflösen des Wirkstoffes in einem inerten organischen Lösungsmittel, z. B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt werden. Bei flüssigen Wirkstoffen kann der Lösungsmittelanteil auch ganz oder teilweise entfallen. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calciumsalze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkyl-arylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Fettalkohol-Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyglykolether, Sorbitanfettsäureester, Polyoxethylensorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

15 Stäubemittel kann man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit feinverteilten, festen Stoffen z. B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Pyrophyllit oder Diatomeenerde erhalten.

20 Granulate können entweder durch Verdünnen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granulierte Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentrationen mittels Bindemitteln, z. B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise, gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln, granuliert werden.

25 In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z. B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-%, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

30 Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

35 Diese oben genannten Formulierungstypen werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

40 Die für diese Formulierungen zu verwendenden Formulierungshilfsmittel (Inertmaterialien, Emulgatoren, Netzmittel, Tenside, Lösungsmittel etc.) sind beispielsweise in Marschen, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood oder "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964 beschrieben.

45 Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granulierte Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

50 Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z. B. zwischen 0,005 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,01 und 5 kg/ha.

Auch Mischungen oder Mischformulierungen mit anderen Wirkstoffen, wie z. B. Insektiziden, Akariziden, 55 Herbiziden, Düngemitteln, Wachstumsregulatoren oder Fungiziden sind gegebenenfalls möglich.

55 Die Erfahrung wird durch nachstehende Beispiele näher erläutert.

Formulierungsbeispiele

55 A. Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gewichtsteile Wirkstoff und 90 Gewichtsteile Talkum oder Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

B. Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile Wirkstoff, 64 Gewichtsteile koalinhaltigen Quarz aus Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonaures Kalium und 1 Gewichtteil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

C. Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile Wirkstoff mit 6 Gewichtsteilen Alkylphenolpolyglykolether (Triton X 207), 3 Gewichtsteilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gewichtsteilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z. B. ca. 255 bis über 377°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

65 D. Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gewichtsteilen Wirkstoffen, 75 Gewichtsteilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gewichtsteilen oxethyliertes Nonylphenol (10 EO) als Emulgator.

Chemische Beispiele

Beispiel 123 (s. Tabelle 1)

1-(5-Chlor-2-trichlormethyl-pyrimidin-4-yloxy)-propansäureethylester 5

Zu einer Lösung von 9,33 g (0,035 mol) 4,5-Dichlor-2-trichlormethyl-pyrimidin und 4,13 g (0,035 mol) 2-Hydroxypropansäureethylester in 150 ml Toluol fügt man 24,15 g (0,175 mol) K₂CO₃ und eine Spatelspitze Triethylbenzylammoniumchlorid. Das Gemisch wird 6 h zum Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlung werden die unlöslichen Bestandteile abgesaugt und das Filtrat im Vakuum eingedampft. Die Substanz fällt als zähes Öl an.

Ausbeute: 11,37 g □ 93,3% d. Th.

NMR (CDCl₃): δ 8,6 (s, 1H); 5,4 (q, 7 = 7 Hz, 1H); 4,2 (q, 7 = 7 Hz, 2H); 1,8 (d, 7 = 7 Hz, 3H); 1,3 (t, 7 = 7 Hz, 3H).

Beispiel 308 (s. Tabelle 1)

2-[5-Chlor-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluorpropyl)-pyrimidin-4-yloxy]-butansäurebenzylamid 15

Zu einer Lösung von 5,61 g (0,02 mol) 5-Chlor-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluorpropyl)-4-hydroxy-pyrimidin und 5,12 g (0,02 mol) 2-Brombutansäurebenzylamid in 80 ml Acetonitril fügt man 4,14 g (0,03 mol) Kaliumcarbonat und eine Spatelspitze Triethylbenzylammoniumchlorid. Das Gemisch wird 10 h zum Rückfluß erhitzt. Danach lässt man auf Raumtemperatur abkühlen, saugt die festen Bestandteile ab und dampft das Filtrat im Vakuum ein. Der anfallende Feststoff wird aus Diisopropylether umkristallisiert.

Ausbeute: 7,6 g □ 83% d. Th.

Schmp: 118 – 120°C

Beispiel 240 (s. Tabelle 1)

2-[4-Methyl-2-(1,1,2,2-tetrafluorethyl)-pyrimidin-6-yloxy]-essigsäure-N-methyl-N-phenyl-amid

Zu einer Lösung aus 4,2 g (0,02 mol) 4-Hydroxy-6-methyl-2-(1,1,2,2-tetrafluorethyl)-pyrimidin und 4,6 g (0,02 mol) Bromessigsäure-N-methyl-N-phenyl-amid in 90 ml Acetonitril fügt man 4,14 g (0,03 mol) K₂CO₃ und eine Spatelspitze Triethylbenzylammoniumchlorid und erhitzt das Reaktionsgemisch 6 h am Rückfluß. Nach Abkühlen werden alle festen Bestandteile abgesaugt und das Filtrat im Vakuum eingedampft. Der angefallene Feststoff wird aus Ethanol umkristallisiert.

Ausbeute: 6,3 g □ 88% d. Th.

Smp: 70 – 71°C.

Beispiel 302 (s. Tabelle 1)

S-[5-Chlor-2-trifluormethyl-pyrimidin-4-yl]-mercaptoessigsäureethylester 40

6,51 g (0,03 mol) 4,5-Dichlor-2-trifluormethyl-pyrimidin und 3,6 g (0,03 mol) Thioglykolsäureethylester werden in 150 ml Ethanol gelöst. Es werden 2,96 g (0,03 mol) Natriumacetat hinzugefügt und der Ansatz 5 h bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend werden die festen Bestandteile abgesaugt und das Filtrat im Vakuum eingedampft. Der anfallende Feststoff wird aus Diisopropylether umkristallisiert.

Ausbeute: 6,67 g □ 74% d. Th.

Smp: 88 – 89°C.

Beispiel 139 (s. Tabelle 1)

N-(5-Brom-2-trichlormethyl-pyrimidin-4-yl)-aminoessigsäureethylester 50

7,8 g (0,025 mol) 5-Brom-4-chlor-2-trichlormethyl-pyrimidin und 3,91 g (0,028 mol) Glycinethylester-Hydrochlorid werden in 90 ml Acetonitril gelöst. Man fügt 5,29 g (0,063 mol) NaHCO₃ hinzu und erhitzt 3 h zum Rückfluß. Nach Abkühlung werden alle festen Bestandteile abgesaugt und das Filtrat im Vakuum eingedampft. Der entstandene Feststoff wird aus Ethanol umkristallisiert.

Ausbeute: 8,8 g □ 93% d. Th.

Smp: 95°C.

Die nachfolgenden in Tabelle 1 aufgelisteten Verbindungen lassen sich gemäß den oben beschriebenen Verfahrensweisen herstellen.

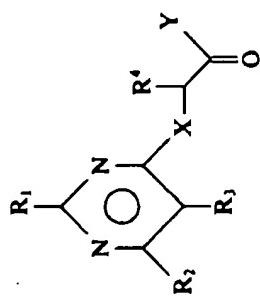
In Tabelle 1 werden die folgenden Abkürzungen benutzt:

Et – Ethyl

Me – Methyl

Bu – n-Butyl

Tabelle 1



Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
1	CCl ₃	Me	H	0	Et	NH—C ₆ H ₅	
2	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHC ₆ H ₄ —4-Cl	
3	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHC ₆ H ₃ —2,4-Cl ₂	
4	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHC ₆ H ₃ —3,5-Cl ₂	
5	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHC ₆ H ₄ —4-Me	
6	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHC ₆ H ₃ —2,4-Me ₂	
7	CCl ₃	Me	H	0	Et	N(Me)(C ₆ H ₅)	83—87
8	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
9	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Me	
10	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Me	105—108
11	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-Me	
12	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Cl	
13	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Cl	
14	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-Cl	
15	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3,4-Cl ₂	
16	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-CF ₃	
17	CCl ₃	Me	H	0	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-CF ₃	

Nr.	R'	R ²	R ³	X	R'	Y	Smp. [°C]
18	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-ClF ₃	
19	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Br	
20	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Br	
21	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-OCH ₃	
22	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-OCH ₃	
23	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-OCH ₃	
24	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-NO ₂	
25	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-NO ₂	
26	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —Naphthyl	
27	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Furyl	
28	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Thienyl	
29	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Pyridyl—3-Cl—4-ClF ₃	
30	CCl ₃	Me	H	O	Et	NH—2-Benzimidazolyl	
31	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —3-Pyridyl	
32	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Pyridyl	
33	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —4-Pyridyl	
34	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —6-Pyrimidinyl—4-Me—2-CCl ₃	
35	CCl ₃	Me	H	O	H	NHCH ₂ —C ₆ H ₅	90–92
36	CCl ₃	Me	H	O	H	N(Me)(C ₆ H ₅)	123–125
37	CCl ₃	Me	H	O	H	NHC ₆ H ₅	
38	CCl ₃	Me	H	O	H	N(Et)(C ₆ H ₅)	
39	CCl ₃	Me	H	O	H	OEt	
40	CCl ₃	Me	H	O	H	OMe	
41	CCl ₃	Me	H	O	H	OCH ₂ C ₆ H ₅	
42	CCl ₃	Me	H	O	Me	OEt	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
43	CCl ₃	Me	H	O	Et	OEt	
44	CCl ₃	Me	H	O	Me	OMe	
45	CCl ₃	Me	H	S	H	OEt	
46	CCl ₃	Me	H	S	H	OMe	
47	CCl ₃	Me	H	S	Et	OEt	
48	CCl ₃	Me	H	S	Et	OMe	
49	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ (cyclo)C ₄ H ₉	
50	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ (cyclo)C ₄ H ₉	
51	CCl ₃	Me	H	O	Et	NEt ₂	
52	CCl ₃	Me	H	O	Et	NMe ₂	
53	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHMe	
54	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHEt	
55	CCl ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
56	CCl ₃	Me	H	NH	H	OEt	
57	CCl ₃	Me	H	NH	H	OMe	
58	CCl ₃	Me	H	NMe	H	Na	112-116
59	CCl ₃	Me	H	NH	H	H	
60	CCl ₃	Me	H	NMe	H	OCH ₃	
61	CCl ₃	Me	H	O	OCH ₃	OCH ₃	
62	CCl ₃	Me	H	O	OEt	OCH ₃	
63	CCl ₃	Me	H	O	OCH ₃	OEt	
64	CCl ₃	Me	H	O	OCH ₃	OEt	
65	CCl ₃	Me	H	O	OCH ₃	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
66	CCl ₃	Me	H	O	OCH ₃	N(Me)(C ₄ H ₉)	
67	CCl ₃	Me	H	S	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	

Nr.	R'	R ²	R ³	X	R'	Y	Smp. [°C]
68	CCl ₃	Me	H	S	Et	N(Me)(C ₄ H ₉)	
69	CCl ₃	Me	H	S	Et	NHCH ₂ (cyclo)C ₆ H ₁₁	
70	CCl ₃	Me	H	S	Et	NHC ₄ H ₉	
71	CCl ₃	Me	H	O	Et	OH	
72	CCl ₃	Me	H	O	Et	OH	
73	CCl ₃	Me	H	O	CH ₃		
74	CCl ₃	(cyclo)C ₄ H ₇	H	O	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
75	CCl ₃	(cyclo)C ₄ H ₉	H	O	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
76	CCl ₃	(cyclo)C ₄ H ₁₁	H	O	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
77	CCl ₃	H	H	O	Et	NHC ₄ H ₉	
78	CCl ₃	H	H	O	H	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
79	CCl ₃	H	H	O	H	N(Me)(C ₄ H ₉)	
80	CCl ₃	H	H	O	H	NH—Naphthyl	
81	CCl ₃	H	H	O	H	NHCH ₂ —cyclo—C ₆ H ₁₁	
82	CCl ₃	H	H	O	C ₂ H ₅	NHC ₄ H ₉	
83	CCl ₃	H	H	O	C ₂ H ₅	NHCH ₂ C ₄ H ₉ —4-Cl	
84	CCl ₃	H	H	O	C ₂ H ₅	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
85	CCl ₃	H	H	O	C ₂ H ₅	NHCH ₂ C ₄ H ₉ —2,4-Me ₂	
86	CCl ₃	H	H	O	CH ₃	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
87	CCl ₃	H	H	O	C ₂ H ₅	N(Me)C ₄ H ₉	
88	CCl ₃	H	H	O	n-C ₃ H ₇	N(Me)C ₄ H ₉	
89	CCl ₃	H	H	O	n-C ₃ H ₇	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
90	CCl ₃	H	H	O	H	OCH ₃	
91	CCl ₃	H	H	O	H	OC ₂ H ₅	
92	CCl ₃	H	H	S	H	OCH ₃	
						Sirup	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
93	CCl ₃	H	H	S	H	OC ₂ H ₅	
94	CCl ₃	H	H	NH	C ₂ H ₅	O ₂ H ₅	
95	CCl ₃	H	H	NH	H	OE _t	Sirup
96	CCl ₃	H	H	NH	H	OBu	
97	CCl ₃	Et	H	O	H	NHEt	
98	CCl ₃	Et	H	O	H	NHMe	
99	CCl ₃	Et	H	O	Et	NHPt	
100	CCl ₃	Et	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
101	CCl ₃	Et	H	O	Et	N(Me)C(C ₆ H ₅)	
102	CCl ₃	Et	H	O	Et	NEt ₂	
103	CCl ₃	Et	H	O	Et	N(Et)C ₆ H ₅)	88-91
104	CCl ₃	Et	H	S	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
105	CCl ₃	Et	H	O	Et	OMe	
106	CCl ₃	Et	H	O	Et	OPr	
107	CCl ₃	Et	H	O	H	OMe	
108	CCl ₃	Et	H	O	H	OE _t	
109	CCl ₃	Et	H	S	Et	NHCH ₂ —2-Furyl	
110	CCl ₃	Et	H	O	Et	OCH ₃	
111	CCl ₃	Et	H	O	Et	OCH ₃	
112	CCl ₃	Et	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
113	CCl ₃	H	C ₁	O	Et	NHC ₆ H ₅	
114	CCl ₃	H	C ₁	O	Et	N(Me)C(C ₆ H ₅)	
115	CCl ₃	H	C ₁	O	H	N(Me)C(C ₆ H ₅)	
116	CCl ₃	H	C ₁	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
117	CCl ₃	H	C ₁	O	Et	OE _t	110-114

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
118	CCl ₃	H	Ci	O	Ei	OMe	
119	CCl ₃	H	Ci	O	H	OMe	Sirup
120	CCl ₃	H	Ci	O	H	OBu	Sirup
121	CCl ₃	H	Ci	S	H	OEi	83-86
122	CCl ₃	H	Ci	S	H	OMe	
123	CCl ₃	H	Ci	O	CH ₃	OEi	Sirup
124	CCl ₃	H	Ci	NH	H	OEi	98-100
125	CCl ₃	H	Ci	NMe	H	OEi	
126	CCl ₃	H	Ci	NH	H	OBu	
127	CCl ₃	H	Br	O	H	OEi	
128	CCl ₃	H	Br	O	H	OMe	Sirup
129	CCl ₃	H	Br	O	Me	OEi	Sirup
130	CCl ₃	H	Br	O	Me	OMe	
131	CCl ₃	H	Br	O	Et	OEi	
132	CCl ₃	H	Br	O	Et	OMe	
133	CCl ₃	H	Br	O	Et	NHC ₄ H ₉	
134	CCl ₃	H	Br	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
135	CCl ₃	H	Br	O	Et	N(Me)C(C ₆ H ₅)	
136	CCl ₃	H	Br	S	H	OEi	92-94
137	CCl ₃	H	Br	S	Et	OEi	ØI
138	CCl ₃	H	Br	S	H	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
139	CCl ₃	H	Br	NH	H	OEi	
140	CCl ₃	H	Br	O	H	NHCH ₂ C ₆ H ₅	95
141	CCl ₃	Ci	H	O	H	OEi	137-142
142	CCl ₃	Ci	H	O	H	OMe	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
143	CCl ₃	Ci	H	O	H	NHCH ₂ C ₄ H ₉	Sirup
144	CCl ₃	Ci	H	O	H	N(Me)(C ₄ H ₉)	
145	CCl ₃	Ci	H	O	H	NHC ₃ H ₇ —4-Cl	
146	CCl ₃	Ci	H	S	H	OEt	53-57
147	CCl ₃	Ci	H	NMe	H	ONa	Sirup
148	CCl ₃	Me	Ci	O	H	OEt	
149	CCl ₃	Me	Ci	O	H	N(Me)(C ₄ H ₉)	143-146
150	CCl ₃	Me	Ci	S	H	OEt	
151	CCl ₃	Me	Ci	S	Et	OMe	
152	CCl ₃	Me	Ci	O	H	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
153	CCl ₃	Me	Ci	O	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
154	CCl ₃	CF ₃	CF ₃	H	O	OEt	
155	CCl ₃	CF ₃	CF ₃	H	O	H	
156	CCl ₃	CF ₃	CF ₃	H	O	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
157	CCl ₃	CF ₃	CF ₃	H	O	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
158	CCl ₃	CF ₃	CF ₃	H	O	OBu	
159	CCl ₃	CF ₃	CF ₃	H	O	N(Me)(C ₄ H ₉)	
160	CCl ₃	H	Me	O	Et	OEt	
161	CCl ₃	H	Me	O	H	OMe	
162	CCl ₃	H	Me	O	H	NHCH ₂ C ₄ H ₉	
163	CCl ₃	H	Me	O	H	NHCH ₂ C ₄ H ₉ —2,4-Me ₂	
164	CCl ₃	H	Me	O	H	N(Me)(C ₄ H ₉)	
165	CCl ₃	H	Me	O	Et	N(Me)(C ₄ H ₉)	
166	CCl ₃	H	Me	O	Et	OMe	
167	CCl ₃	H	Me	O	Et	NHCH ₂ C ₄ H ₉	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
168	CCl ₃	H	Me	O	Et	NHCH ₂ —2-Furyl	
169	CCl ₃	H	Me	S	OEt		
170	CCl ₃	H	Me	S	OEt		
171	CCl ₃	H	Me	S	OMe		
172	CCl ₃	H	Me	NH	83–87		
173	CCl ₃	H	Me	O	Sirup		
174	CCl ₃	CICH ₂	H	O	OEt		
175	CCl ₃	CICH ₂	H	O	OMe		
176	CCl ₃	CICH ₂	H	O	OEt		
177	CCl ₃	CICH ₂	H	O	OMe		
178	CCl ₃	CICH ₂	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
179	CCl ₃	CICH ₂	H	O	Et	N(Me)(C ₆ H ₅)	49–52
180	CCl ₃	n-Pr	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
181	CCl ₃	n-Pr	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
182	CCl ₃	n-Pr	H	O	Et	N(Me)(C ₆ H ₅)	
183	CCl ₃	OMe	H	O	OMe		
184	CCl ₃	OEt	H	O	OEt		
185	CCl ₃	SCH ₃	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
186	CCl ₃	NMe ₂	H	O	Et	NHCH ₂ —4-Pyridyl	
187	CCl ₃	cyclo-C ₃ H ₁₁	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
188	CCl ₃	cyclo-C ₃ H ₁₁	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
189	CF ₂ CF ₃	H	Cl	O	H		
190	CF ₂ CF ₃	H	Cl	O	OMe		
191	CF ₂ CF ₃	H	Cl	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
192	CF ₂ CF ₃	H	Cl	S	H	OEt	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
193	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	H	OEi	
194	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	S	Ei	OEi	
195	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₅	Sirup
196	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	Ei	OEi	
197	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	Ei	OMe	
198	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	S	H	OEi	
199	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	H	N(Me)C(C ₆ H ₅)	83-84
200	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	H	NMe ₂	
201	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	H	NMe ₂	
202	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	Ei	N(Me)C(C ₄ H ₉)	69-70
203	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
204	CF ₂ CHF ₂	H	Ci	O	H	NHCH ₂ C ₆ H ₅	76-78
205	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NH—C ₆ H ₅	
206	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHC ₄ H ₉ —4-Cl	
207	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHC ₄ H ₉ —2,4-Cl ₂	
208	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHC ₄ H ₉ —3,5-Cl ₂	
209	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHC ₄ H ₉ —4-Me	
210	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHC ₄ H ₉ —2,4-Me ₂	
211	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	N(Me)C(C ₄ H ₉)	70-71
212	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₅	99-103
213	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Me	
214	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Cl	
215	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-Me	
216	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Cl	
217	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Ei	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Cl	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. (°C)
218	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-Cl	
219	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3,4-Cl ₂	
220	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-CF ₃	
221	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-CF ₃	
222	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-CF ₃	
223	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Br	
224	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Br	
225	CF ₂ CHF ₃	Me	F	O	Et	NHC(=O)H—2-OCH ₃	
226	CF ₂ CHF ₃	Me	I	O	Et	NH—I—2,4,6-OCH ₃	
227	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-OCH ₃	
228	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-NO ₂	
229	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-NO ₂	
230	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —Naphthyl	
231	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Furyl	
232	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Thienyl	
233	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Pyridyl—3-Cl—4-CF ₃	
234	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NH—2-Benzimidazolyl	
235	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —3-Pyridyl	
236	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Pyridyl	
237	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —4-Pyridyl	
238	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —4-Pyrimidinyl—6-Me—2-CCl ₃	
239	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	H	N(Me)C ₆ H ₅	
240	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	H	NHC ₆ H ₅	
241	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	H	N(Et)C ₆ H ₅	
242	CF ₂ CHF ₃	Me	H	O	H		

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
243	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	H	OEt	
244	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	H	OMe	
245	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	H	OCH ₂ C ₆ H ₅	
246	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Me	OEt	
247	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	OEt	
248	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Me	OMe	
249	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	H	OEt	
250	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	H	OMe	
251	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	H	OEt	
252	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	Et	OMe	
253	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —cyclo-C ₆ H ₁₁	
254	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —cyclo-C ₆ H ₉	
255	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et ₂		
256	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	NMe ₂	
257	CF ₂ CHF ₂	Me	H	—	Et	NHMe	
258	CF ₂ CHF ₂	Me	H	C	Et	NHEt	
259	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
260	CF ₂ CHF ₂	Me	H	NH	H	OEt	75-78
261	CF ₂ CHF ₂	Me	H	NH	H	OMe	
262	CF ₂ CHF ₂	Me	H	NMe	H	Na	112-116
263	CF ₂ CHF ₂	Me	H	NMe	H	H	
264	CF ₂ CHF ₂	Me	H	NH	H	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
265	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	OCH ₃	OCH ₃	
266	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	OEt	OCH ₃	
267	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	OCH ₃	OEt	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
268	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	OCH ₃	OEt	
269	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	OCH ₃	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
270	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	OCH ₃	N(Me)C ₆ H ₅	
271	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
272	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	Et	N(Me)C ₆ H ₅	
273	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	Et	NHCH ₂ —cyclo-C ₆ H ₁₁	
274	CF ₂ CHF ₂	Me	H	S	Et	NHC ₆ H ₅	
275	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	OH	
276	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	OH	
277	CF ₂ CHF ₂	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
278	CF ₂ CHF ₂		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
279	CF ₂ CHF ₂		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
280	CF ₂ CHF ₂		cyclo-C ₆ H ₁₁	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅
281	CF ₂ CHF ₂	H	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Thienyl	
282	CF ₂ CHF ₂	H	H	O	Et	OEt	
283	CF ₂ CHF ₂	Et	H	O	Et	OMe	
284	CF ₂ CHF ₂	Et	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	77-79
285	CF ₂ CHF ₂	Et	H	O	Et	OEt	
286	CF ₂ CHF ₂	Et	H	O	Et	NHC ₆ H ₅	
287	CF ₂ CHF ₂		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
288	CF ₂ CHF ₂		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R'	Y	Smp. [°C]
289	CF ₃ CHF ₂	H	CH ₃	O	E _t	OEt	
290	CF ₃ CHF ₂	H	CH ₃	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅	72-76
291	CF ₃ CHF ₂	H	CH ₃	O	H	OEt	
292	CF ₃ CHF ₂	H	CH ₃	O	H	OMe	
293	CF ₃ CHF ₂	Cl	H	O	H	NHCH ₂ C ₆ H ₅ —2-Cl	
294	CF ₃ CHF ₂	MeO	H	S	Me	N(Et) ₂	
295	CF ₃ CHF ₂	n-Pr	H	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
296	CF ₃ CHF ₂	n-Pr	H	O	E _t	NHC ₄ H ₉	
297	CF ₃ CHF ₂	n-Pr	H	O	E _t	N(Et)X(C ₆ H ₅)	
298	CF ₃ CHF ₂	n-Pr	H	O	E _t	N(Me)X(C ₆ H ₅)	
299	CF ₃ CHF ₂	CH ₃	Cl	O	E _t	NCH ₂ C ₆ H ₅	
300	CF ₃	H	Cl	O	H	OCH ₃	65-68
301	CF ₃	H	Cl	O	E _t	OEt	Sirup
302	CF ₃	H	Cl	S	H	OEt	
303	CF ₃ CHFCF ₃	H	Cl	O	E _t	OEt	88-89
304	CF ₃ CHFCF ₃	H	Cl	O	H	OMe	145-148
305	CF ₃ CHFCF ₃	CH ₃	H	S	H	OEt	Sirup
306	CF ₃ CHFCF ₃	CH ₃	H	NH	H	OEt	
307	CF ₃ CHFCF ₃	H	H	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅	111
308	CF ₃ CHFCF ₃	H	Cl	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅	118-120
309	(CF ₃) ₂ CF ₃	H	Cl	O	E _t	OBu	
310	(CF ₃) ₂ CF ₃	Cl	H	NH	H	OEt	
311	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅ —3-Cl ₃	
312	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅ —4-Cl ₃	
313	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E _t	NHCH ₂ C ₆ H ₅ —4-Br	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
314	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Br	
315	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-OCH ₃	
316	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-OCH ₃	
317	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-OCH ₃	
318	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-NO ₂	
319	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-NO ₂	
320	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —Naphthyl	
321	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Furyl	
322	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Thienyl	
323	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Pyridyl—3-Cl—4-CF ₃	
324	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NH—2-Benzimidazolyl	
325	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —3-Pyridyl	
326	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —2-Pyridyl	
327	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —4-Pyridyl	
328	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	NHCH ₂ —6-Pyrimidinyl—4-Me—2-CCl ₃	
329	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	NH	H	OEt	75–78
330	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	NH	H	OMe	
331	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	NMe	H	Na	112–116
332	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	NMe	H	H	
333	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	NH	H	NHCH ₂ C ₆ H ₄	
334	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	OCH ₃	OCH ₃	
335	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	OEt	OCH ₃	
336	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	OCH ₃	OEt	
337	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	OCH ₃	OEt	
338	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	OCH ₃	NHCH ₂ C ₆ H ₄	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R'	Y	Smp. (°C)
339	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	OCH ₃	N(Me)(C ₆ H ₅)	
340	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
341	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	Et	N(Me)(C ₆ H ₅)	
342	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	Et	NHCH ₂ ,—cyclo-C ₄ H ₁₁	
343	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	Et	NHC ₆ H ₅	
344	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	OH	
345	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	CH ₃	OH	
346	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	OH	
347	(CF ₃) ₂ CF ₃		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
348	(CF ₃) ₂ CF ₃		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
349	(CF ₃) ₂ CF ₃		H	O	Et	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
350	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	NHCH ₂ ,—C ₆ H ₅	
351	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	N(Me)(C ₆ H ₅)	
352	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	NHC ₆ H ₅	
353	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	N(Et)(C ₆ H ₅)	
354	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	OEt	
355	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	OMe	
356	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	H	OCH ₂ C ₆ H ₅	
357	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Me	OEt	
358	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Et	OEt	
359	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	Me	OMe	
360	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	H	OEt	
361	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	H	OMe	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
362	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	E ₁	OEt	
363	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	S	E ₁	OMe	
364	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₃ ,—cyclo-C ₄ H ₁₁	
365	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₃ ,—cyclo-C ₄ H ₁₁	
366	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NEt ₂	
367	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NMe ₂	
368	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHMe	
369	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHEt	
370	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
371	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NH—C ₆ H ₅	
372	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHC ₆ H ₅ —4-Cl	
373	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHC ₆ H ₅ —2,4-Cl ₂	
374	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHC ₆ H ₅ —3,5-Cl ₂	
375	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHC ₆ H ₅ —4-Me	
376	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHC ₆ H ₅ —2,4-Me ₂	
377	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	N(Me)(C ₆ H ₅)	
378	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₅	
379	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Me	
380	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Me	
381	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-Me	
382	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-Cl	
383	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —4-Cl	
384	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3-Cl	
385	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —3,4-Cl ₂	
386	(CF ₃) ₂ CF ₃	Me	H	O	E ₁	NHCH ₂ C ₆ H ₄ —2-ClF ₃	

Nr.	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	Y	Smp. [°C]
387	CCl ₃	H	H	NH	Et	OEt	
388	CCl ₃	H	H	NH	CH ₃	OH	
389	CCl ₃	H	H	NH	CH ₃	ONa	
390	CCl ₃	H	H	NMe	H	OEt	
391	CCl ₃	H	H	NMe	H	ONa	
392	CCl ₃	H	H	NMe	H	OH	
							Sirup

Biologische Beispiele

Die Schädigung der Unkrautpflanzen bzw. die Kulturpflanzenverträglichkeit wurde gemäß einem Schlüssel bonitiert, in dem die Wirksamkeit durch Wertzahlen von 0–5 ausgedrückt ist. Dabei bedeutet:

- 0 = ohne Wirkung bzw. Schaden
- 1 = 0–20% Wirkung bzw. Schaden
- 2 = 20–40% Wirkung bzw. Schaden
- 3 = 40–60% Wirkung bzw. Schaden
- 4 = 60–80% Wirkung bzw. Schaden
- 5 = 80–100% Wirkung bzw. Schaden

5

10

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

1. Unkrautwirkung im Voraufrauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen wurden in Plastiktöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbarer Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfundungsgemäßen Verbindungen wurden dann als wässrige Suspensionen bzw. Emulsionen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600–800 l/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert. Nach der Behandlung wurden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. der Auflaufschäden erfolgte nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen nach einer Versuchszeit von 3–4 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen.

Wie die Boniturwerte in Tabelle 2 zeigen, weisen die erfundungsgemäßen Verbindungen eine gute herbizide Voraufraufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf.

Tabelle 2

Wirkung der erfundungsgemäßen Verbindungen im Voraufrauf

Verbind. gem. Bsp.	Dosis (kg a.i./ha)	herbizide Wirkung STM	SIA	LOM	ECG
8	2,5	5	5	5	5
10	2,5	5	5	5	5
307	2,5	3	5	3	5
84	2,5	5	5	5	5
132	2,5	5	5	4	4
119	2,5	5	5	5	5
128	2,5	5	5	2	3
90	2,5	5	5	5	3
300	2,5	4	4	1	4
121	2,5	5	5	1	1
302	2,5	4	5	3	4
95	2,5	5	5	2	2
124	2,5	5	3	2	4

Abkürzungen:

STM = *Stellaria media*SIA = *Sinapis alba*LOM = *Lolium multiflorum*ECG = *Echinochloa crus-galli*

2. Unkrautwirkung im Nachauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkräutern wurden in Plastiktöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Drei Wochen nach der Aussaat wurden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt.

Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfundungsgemäßen Verbindungen wurden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600–800 l/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprührt und nach ca. 3–4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen die Wirkung der Präparate optisch im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert.

Die erfundungsgemäßen Mittel weisen auch im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger Ungräser und Unkräuter auf (Tabelle 3).

Tabelle 3

Wirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen im Nachlauf

5	Verbind. gem. Bsp.	Dosis (kg a.i./ha)	herbizide Wirkung STM	SIA	LOM	ECG
10	140	2,5	5	5	3	3
	35	2,5	3	4	3	3
	8	2,5	4	5	3	4
	10	2,5	4	5	3	4
	307	2,5	3	5	2	4
	84	2,5	3	4	2	5
15	132	2,5	4	5	1	1
	197	2,5	3	3	1	4
	304	2,5	5	5	2	4
	119	2,5	4	5	1	4
	128	2,5	5	5	2	3
20	161	2,5	4	5	2	3
	90	2,5	5	4	1	4
	300	2,5	5	3	2	2
	121	2,5	4	5	1	1
	302	2,5	4	5	2	2

25

3. Kulturpflanzenverträglichkeit

In weiteren Versuchen im Gewächshaus wurden Samen einer größeren Anzahl von Kulturpflanzen und Unkräutern in sandigem Lehm Boden ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Ein Teil der Töpfe wurde sofort wie unter 1. beschrieben behandelt, die übrigen im Gewächshaus aufgestellt, bis die Pflanzen zwei bis drei echte Blätter entwickelt hatten und dann mit den erfindungsgemäßen Substanzen in unterschiedlichen Dosierungen, wie unter 2. beschrieben, besprüht.

Vier bis fünf Wochen nach Applikation und Standzeit im Gewächshaus wurde mittels optischer Bonitur festgestellt, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie z. B. Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben und Kartoffeln im Vor- und Nachlaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt ließen. Einige Substanzen schonten darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie z. B. Gerste, Weizen, Roggen, Sorghum-Hirschen, Mais oder Reis. Die Verbindungen der Formel I weisen somit eine hohe Selektivität bei Anwendung zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen auf.

4. Herbizide Wirkung bei Anwendung in Reis

Knollen und Rhizome bzw. Jungpflanzen oder Samen verschiedener Reisunkräuter wie Cyperus-Arten, Eleocharis, Scirpus und Echinochloa wurden in geschlossenen Plastiktöpfen in spezielle Reiserde ausgelegt bzw. gepflanzt und mit Wasser bis zu einer Höhe von 1 cm über dem Boden angestaut. Ebenso wurde mit Reispflanzen verfahren.

Im Vorauflaufverfahren, d. h. 3—4 Tage nach dem Verpflanzen wurden die erfindungsgemäßen Verbindungen in Form wäßriger Suspensionen oder Emulsionen ins Anstauwasser gegossen oder als Granulate ins Wasser gestreut.

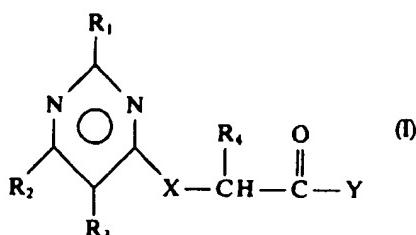
Jeweils drei Wochen später wurde die herbizide Wirkung und eine eventuelle Schadwirkung gegenüber Reis optisch bonitiert. Die Ergebnisse zeigten, daß sich die erfindungsgemäßen Verbindungen zur selektiven Unkrautbekämpfung eignen.

Gegenüber bisherigen Reisherbiziden zeichnen sich die erfindungsgemäßen Verbindungen dadurch aus, daß sie zahlreiche, insbesondere auch schwer bekämpfbare Unkräuter, die aus Dauerorganen keimen, wirkungsvoll bekämpfen und dabei von Reis toleriert werden.

Patentansprüche

60 1. Verbindungen der Formel I oder deren Salze,

65



5

10

worin

 R_1 ($C_1 - C_8$)-Haloalkyl; R_2 Wasserstoff, Halogen, Cyano, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, das ein- oder mehrfach durch Halogen, Nitro, Cyano, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio oder $-NR_5R_6$ substituiert sein kann; ($C_2 - C_4$)-Alkenyl, ($C_2 - C_4$)-Alkynyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio, ($C_1 - C_4$)-Alkylsulfonyl, ($C_3 - C_8$)-Cycloalkyl, das durch ($C_1 - C_4$)-Alkyl ein- oder mehrfach substituiert sein kann; Phenoxy, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO_2 , ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkoxy substituiert ist; R_3 Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, Halogen oder Cyano; R_4 Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkoxy; X O, S oder NR_5 ; Y einen Rest $-NR_5R_6$ oder $-OR_6$; R_5 Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl; R_6 ($C_1 - C_4$)-Alkyl, CH_2R_7 , Phenyl oder Naphthyl, die beide gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO_2 , ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, Cyano oder ($C_1 - C_4$)-Alkylthio substituiert sein können; R_7 Phenyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO_2 , ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio oder Cyano substituiert ist, ($C_3 - C_8$)-Cycloalkyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch ($C_1 - C_4$)-Alkyl substituiert sein kann, Furyl, Thienyl, Pyridyl oder Pyrimidinyl, wobei diese Reste jeweils gegebenenfalls durch Halogen, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkyl substituiert sein können; und R_8 Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkylbedeuten, mit der Maßgabe, daß diejenigen Verbindungen der Formel I, worin $R_1 CF_3$, X Sauerstoff und $R_6CH_2R_7$ bedeutet, ausgenommen sind.

2. Verbindungen der Formel I von Anspruch 1, worin

35

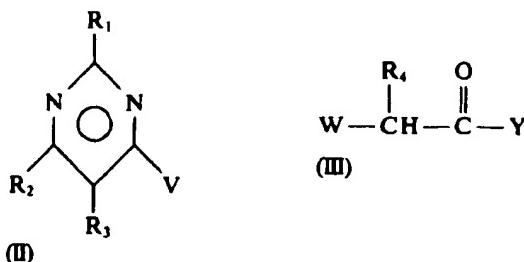
 R_1 ($C_1 - C_8$)-Haloalkyl, insbesondere die Reste $-CCl_3$, $-CF_2CHF_2$ oder $-CF_2CF_3$; R_2 ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl oder ($C_3 - C_8$)-Cycloalkyl; R_3 Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl oder Halogen; R_4 Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl oder ($C_1 - C_4$)-Alkoxy; X O oder S;

40

 Y NR_5R_6 oder OR_8 ; R_5 Wasserstoff, ($C_1 - C_4$)-Alkyl; R_6 $-CH_2R_7$, Phenyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO_2 , ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy oder ($C_1 - C_4$)-Alkylthio substituiert sein kann; R_7 Phenyl, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen, NO_2 , ($C_1 - C_4$)-Alkyl, ($C_1 - C_4$)-Haloalkyl, ($C_1 - C_4$)-Alkoxy, ($C_1 - C_4$)-Alkylthio oder Cyano substituiert sein kann; R_8 Wasserstoff oder ($C_1 - C_4$)-Alkylbedeuten, mit der Maßgabe, daß diejenigen Verbindungen der Formel I, worin $R_1 CF_3$, X Sauerstoff und $R_6CH_2R_7$ bedeutet, ausgenommen sind.

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I von Ansprüchen 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II in Gegenwart einer Base mit einer Verbindung

50



55

60

der Formel III umsetzt.

65

4. Herbizide Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine Verbindung der Formel I von Ansprüchen 1 oder 2 oder deren Salze neben üblichen Trägerstoffen enthalten.

5. Verwendung von Verbindungen der Formel I von Anspruch 1 oder 2 oder deren Salze als Herbizide.

OS 38 07 532

6. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die Kulturböden eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I von Anspruch 1 oder 2 oder deren Salze appliziert.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.